

146261

146261



MEMORIA DESCRIPTIVA

para

CLARKE, MODET Y CIA
solicitar una PATENTE de INVENCION por VEINTE años, en ESPAÑA, por un "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE PRODUCTOS DE CONDENSACION", a favor de la razón social I.G. FARBENINDUSTRIE AKTIENGESELLSCHAFT, domiciliada en Frankfurt a Main (Alemania).

====ooOoo====

La 4.4'-diaminodifenilsulfona y la 4.4'-diacetil-diaminodifenilsulfona muestran una buena actividad contra las

infecciones de los estreptococos y pneumococos producidas en las ratas, reduciéndose la utilidad de la 4.4'-diaminodifenilsulfona por una fuerte formación de methemoglobina.

Ahora bien, se ha descubierto que se obtienen compuestos que manifiestan una actividad distintamente aumentada en comparación a los productos arriba indicados, condensando la 4.4'-diaminodifenilsulfona con aldehidos. Tales productos de condensación de la 4.4'-diaminodifenilsulfona no muestran dicha formación de methemoglobina. Para obtener los nuevos compuestos se procede según métodos de por sí conocidos. Según sea la actividad de los aldehidos se obtienen productos de condensación conteniendo una o dos moléculas de aldehido. También es posible llevar los aldehidos menos activos a la condensación con ambos grupos amínicos, aplicando condiciones de reacción más enérgicas, por ejemplo fundiendo los componentes uno con otro a unos 150 - 180°. La condensación puede también realizarse gradualmente, sintetizando primero las 4-amino-4'-azometinodifenilsulfonas, preferentemente por medio de los aldehidos menos activos, y haciéndolas reaccionar ulteriormente con aldehidos. En éste caso también es posible obtener compuestos asimétricos por aplicación de diversos aldehidos.



BLANKE MOEY Y CA

25

E J E M P L O 1º.
=====

24.8 grs. de 4.4'-diaminodifenilsulfona se calientan hasta la ebullición durante 15 minutos juntos con 30 grs. de aldehido cinámico en 300 cm³ de alcohol. Ya a la temperatura de la ebullición el producto de condensación empieza a separarse. Después del enfriamiento el producto

30

de condensación se recoge por aspiración y se lava con alcohol y éter. De ésta manera se obtiene la 4.4'-bis-(cinamoidenamino)-difenilsulfona en forma de hojitas de color amarillo claro del punto de fusión a 236°. De un modo análogo se obtiene:

35

la 4.4'-bis-propilidenamino-difenilsulfona del punto de fusión a 246° por aplicación de aldehído propiónico,

la 4-benzilidenamino-4'-amino-difenilsulfona del punto de fusión a 214° por aplicación de benzaldehído,

40

la 4.4'-bis-(4''-metil-benzilidenamino)-difenilsulfona del punto de fusión a 250° por aplicación de 4-tolilaldehído,

la 4.4'-bis-(2''-oxi-benzilidenamino)-difenilsulfona del punto de fusión a 259° por aplicación de 2-oxibenzaldehído,

la 4-(4''-metoxi-benzilidenamino)-4'-amino-difenilsulfona del punto de fusión a 226° por aplicación de 4-metoxibenzaldehído,

la 4.4'-bis-(4''-cloro-benzilidenamino)-difenilsulfona del punto de fusión a 233° por aplicación de 4-clorobenzaldehído,

la 4-(3'',4''-metilenodioxibenzilidenamino)-4'-amino-difenilsulfona del punto de fusión a 227° por aplicación de 3.4-metilenodioxibenzaldehído.

55

Según sea el grado de pureza de las materias de partida pueden variar los puntos de fusión de los productos de condensación antedichos; una purificación ulterior de los productos no es posible, por regla general, porque se disuelven sino difícilmente en disolventes orgánicos.



CLARKE, MODET Y CA.
50

60

En muchos casos la condensación resulta especialmente sencilla por medio de diaminodifenilsulfona industrial que aún contiene pequeñas cantidades de su dihidrocloruro.

65

En éste caso se obtiene, por ejemplo por condensación con 3.4-metileno-dioxibenzaldehído, directamente la 4.4'-bis-(3'',4''-metileno-dioxibenzilidenamino)-difenilsulfona del punto de fusión a 231°.

70

De la manera arriba descrita pueden también transformarse otros aldehidos como, por ejemplo, el aldehído valérico, el aldehído butírico, nitrobenzaldehydos, la vanilina, el acetilaminobenzaldehído, la glucosa, la galactosa, la maltosa, el furfurool, la alfa-furil-acroleína.

E J E M P L O 2°.

=====

10 grs. de 4.4'-diaminodifenilsulfona y 25 grs. de 4-clorobenzaldehído se calientan a 170 - 180°, haciendo pasar por la mezcla una corriente moderada de nitrógeno, hasta que se haya eliminado por destilación el agua separada durante la condensación (al cabo de unos 10 minutos). Una vez enfriada la masa fundida, se la pulveriza y se la extrae mediante éter en ebullición, quedando indisuelta la 4.4'-bis-(4''-clorobenzilidenamino)-difenilsulfona, que se recoge por aspiración y se funde a 233°. El rendimiento alcanza un 90 % de la teoría.

80

De un modo correspondiente se obtiene la 4.4'-bis-benzilidenamino-difenilsulfona del punto de fusión a 236° por aplicación de benzaldehído, y la 4.4'-bis-(4''-metoxibenzilidenamino)-difenilsulfona del punto de fusión a 241° por aplicación de 4-metoxibenzaldehído.

85



E J E M P L O 3º.
=====

10 grs. de la 4-(4''-metoxi-benzilidenamino)-4'-
 90 amino-difenilsulfona del punto de fusión a 226º obtenible
 según las indicaciones del ejemplo 1º, se calientan a 170 -
 180º con 20 grs. de 4-metoxi-benzaldehido, haciendo pasar
 por la mezcla una corriente moderada de nitrógeno, hasta que
 el agua formada durante la reacción se haya eliminado por
 95 destilación. La masa en fusión se introduce, agitando, en
 alcohol caliente, el precipitado se recoge por aspiración
 y se lava con alcohol y éter, obteniéndose así la 4.4'-bis-
 (4''-metoxibenzilidenamino)-difenilsulfona en forma de cris-
 tales incoloros del punto de fusión a 240º.

100

R E I V I N D I C A C I O N E S
=====

1).- Procedimiento para la obtención de productos
 de condensación, caracterizado porque se condensa la 4.4'-
 diamino-difenilsulfona con aldehidos.

105

2).- Modo para llevar a la práctica el procedi-
 miento según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la
 condensación se realiza gradualmente.

3).- Modo para llevar a la práctica los procedi-
 mientos según las reivindicaciones 1ª y 2ª, caracterizado
 porque el aldehido contiene substituyentes, por ejemplo gru-
 110 pos hidroxí, alcoxí o átomos de halógeno.

4ª.- Procedimiento para la obtención de productos
 de condensación, con arreglo a la presente memoria descripti-
 va y reivindicaciones anteriores. 19 October 28

CLARKE, MODET Y C^o.

==oo00oo==



[Handwritten signature]